

**COSMETIC****Publication number:** JP8109121**Publication date:** 1996-04-30**Inventor:** KIMURA HIDEO; JOKURA YOJI; KAMISAKA TOSHIO;  
OKADA CHIHARU**Applicant:** KAO CORP**Classification:****- International:** A61K8/30; A61K8/00; A61K8/06; A61K8/37; A61K8/42;  
A61K8/55; A61K8/58; A61K8/68; A61K8/92;  
A61Q19/00; A61K8/30; A61K8/00; A61K8/04;  
A61K8/92; A61Q19/00; (IPC1-7): A61K7/48; A61K7/00**- European:****Application number:** JP19940247453 19941013**Priority number(s):** JP19940247453 19941013**Report a data error here****Abstract of JP8109121**

**PURPOSE:** To obtain a cosmetic, excellent in preservation stability and capable of imparting persistent humectant effects to the skin. **CONSTITUTION:** This cosmetic contains (A) a ceramide or its analogous substance, e.g. a ceramide of formula I (R<1> and R<2> are each a 10-26C straight-chain or branched chain saturated or unsaturated hydrocarbon group substitutive with one or more OH groups) or formula II (R<3> is a 10-26C straight-chain or branched saturated or unsaturated hydrocarbon group) and (B) an oily base having  $\leq 30$ , especially  $\leq 10$  compatibility value (Ri <2> ) with the component (A) calculated by a three-dimensional solubility parameter method, preferably an ester of a polyhydric alcohol with a fatty acid, especially octyldodecyl lactate or diisostearic acid diglycerol. The amounts of both the ingredients are within the range of preferably 0.1-50wt.%, especially 1-20wt.% ingredient (A) and preferably 0.1-70wt.%, especially 1-30wt.% ingredient (B). Cholesterol (derivative) or a fatty acid can be blended in the cosmetic to thereby further improve the humectant properties and feeling of use.

---

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平8-109121

(43)公開日 平成8年(1996)4月30日

(51)Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K	7/48			
	7/00	N		
		C		
		E		

審査請求 未請求 請求項の数4 O L (全 5 頁)

(21)出願番号	特願平6-247453	(71)出願人	000000918 花王株式会社 東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号
(22)出願日	平成6年(1994)10月13日	(72)発明者	木村 秀雄 千葉県松戸市五香六実5-120 キャピタルB-102
		(72)発明者	城倉 洋二 栃木県宇都宮市山本3丁目2-5
		(72)発明者	上坂 敏雄 埼玉県熊谷市玉井2063-2
		(72)発明者	岡田 千春 大阪府泉南郡岬町淡輪2321-3
		(74)代理人	弁理士 有賀 三幸 (外3名)

(54)【発明の名称】 化粧品

(57)【要約】

【構成】 (a) セラミド又はその類似構造物質、及び  
(b) 三次元溶解度パラメーター法により計算された  
(a) 成分との相溶性値 (R i<sup>2</sup>) が30以下である油性基剤を含有する化粧品。

【効果】 (b) 成分の作用により (a) 成分を安定に配合できるため保存安定性が優れており、更に (a) 成分の作用により皮膚に持続性のある保湿効果が付与できる。

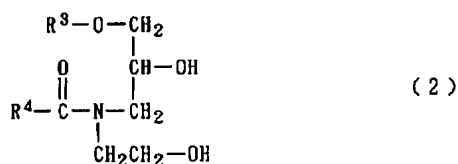
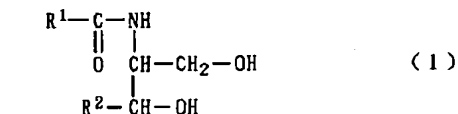
1

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 (a) セラミド又はその類似構造物質、及び (b) 三次元溶解度パラメーター法により計算された (a) 成分との相溶性値 ( $R_{12}$ ) が30以下である油性基剤を含有することを特徴とする化粧料。

【請求項2】 (a) 成分が、次の一般式 (1) 又は (2) ;

【化1】



【式 (1) 中、 $R^1$  及び  $R^2$  は1以上のヒドロキシル基で置換されていてもよい炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示す。式 (2) 中、 $R^3$  は炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示し、 $R^4$  は炭素数9~25の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示す] で表されるセラミド又はその類似構造物質である請求項1記載の化粧料。

【請求項3】 (b) 成分が乳酸オクチルドデシル又はジイソステアリン酸ジグリセリンである請求項1記載の化粧料。

【請求項4】 乳化型化粧料である請求項1記載の化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は、保湿性に優れ、保存安定性も良好な化粧料に関する。

【0002】

【従来の技術】 従来、化粧料用の保湿剤としては、グリセリン、ソルビトール、1, 3-ブチレングリコール等の低分子量水親和性物質; アミノ酸、ピロリドンカルボン酸ナトリウム、尿素等のNMF (天然保湿因子) 成分; ムコ多糖類、コラーゲン等の高分子生体抽出物等が用いられている。これらの保湿剤はいずれも水との親和性により水分を保持し、保湿効果を発揮するものであるが、その効果は一時的であり、根本的に角質層の水分保持能力を改善し、持続的な保湿効果を付与するものではない。

【0003】 一方、角質細胞間脂質は、角質層の水分保持に重要な役割を果たしていることが知られており、このような脂質又はその類似構造物質を含有した化粧料も提案されている。しかしながら、これらの脂質又はその類

2

似構造物質を単に化粧料に配合しただけでは、必ずしもその効果を充分に得ることはできず、しかも保存安定性も満足できるものではなかった。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】 従って、本発明は上記問題点を解決し、保湿性に優れるとともに保存安定性も良好な化粧料を提供することを目的とする。

【0005】

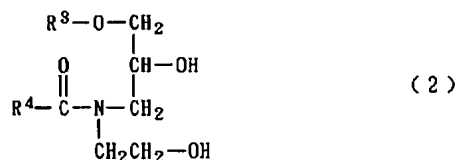
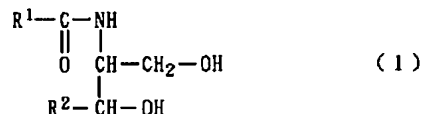
【課題を解決するための手段】 かかる実情において、本発明者らは鋭意研究を重ねた結果、セラミド又はその類似構造物質と、これと相溶性のよい特定の油性基剤とを組み合わせることにより、保湿性に優れ、しかも使用感の良好な化粧料が得られることを見出し、本発明を完成した。

【0006】 すなわち、本発明は、(a) セラミド又はその類似構造物質、及び (b) 三次元溶解度パラメーター法により計算された (a) 成分との相溶性値 ( $R_{12}$ ) が30以下である油性基剤を含有することを特徴とする化粧料を提供するものである。

【0007】 本発明で用いる (a) 成分のセラミド又はその類似構造物質は、哺乳動物脳組織等の天然物から抽出されたものであっても、合成されたものであってもよい。具体的には、次の一般式 (1) 又は (2) ;

【0008】

【化2】



【0009】 【式 (1) 中、 $R^1$  及び  $R^2$  は1以上のヒドロキシル基で置換されていてもよい炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示す。式 (2) 中、 $R^3$  は炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示し、 $R^4$  は炭素数9~25の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基を示す] で表されるセラミド又はその類似構造物質を挙げることができる。

【0010】 一般式 (1) 中、 $R^1$  及び  $R^2$  で示される炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基としては、例えばデシル基、ウンデシル基、ドデシル基、トリデシル基、テトラデシル基、ペンタデシル基、ヘキサデシル基、ヘプタデシル基、オクタデシル基、ノナデシル基、エイコシル基、ヘンエイコシル基、ドコシル基、トリコシル基、テトラコシル基、ペン

タコシル基、ヘキサコシル基、2-ヘプチルウンデシル基、5, 7, 7-トリメチル-2-(1, 3, 3-トリメチルブチル)-オクチル基、2-ヘキシルデシル基、2-オクチルウンデシル基、2-デシルテトラデシル基等のアルキル基；デセニル基、ドデセニル基、ウンデセニル基、トリデセニル基、テトラデセニル基、ペンタデセニル基、ヘキサデセニル基、ヘプタデセニル基、オクタデセニル基、ノナデセニル基、エイコセニル基、ヘンエイコセニル基、ドコセニル基、トリコセニル基、テトラコセニル基、ペンタコセニル基、ヘキサコセニル基、ノナジエニル基、デカジエニル基、ドデカジエニル基、ウンデカジエニル基、トリデカジエニル基、テトラデカジエニル基、ペンタデカジエニル基、ヘキサデカジエニル基、ヘプタデカジエニル基、オクタデカジエニル基、ノナデカジエニル基、イコサジエニル基、ヘンイコサジエニル基、ドコサジエニル基、トリコサジエニル基、テトラコサジエニル基、ペンタコサジエニル基、ヘキサコサジエニル基、9-オクタデセニル基、9, 12-オクタデカジエニル基等を挙げることができる。これらの炭化水素基は1以上のヒドロキシル基で置換されていてもよい。また、式(2)中、 $R^3$ で示される炭素数10~26の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基としては、前記と同様のものを挙げることができ、更に、 $R^4$ で示される炭素数9~25の直鎖又は分岐鎖の飽和又は不飽和の炭化水素基としては、ノニル基、ノネニル基等に加えて前記と同様の炭素数25までのものを挙げ\*

$$Ri^2 = 4(\delta_{di} - \delta_{ds})^2 + (\delta_{pi} - \delta_{ps})^2 + (\delta_{hi} - \delta_{hs})^2$$

$Ri^2$  : 相溶性値 (J/cm<sup>3</sup>)

$\delta_d$  : Londonの分散力(ファンデルワース力)による項であり、 $\delta_d = \Sigma F_d / V$ により計算される。

$\delta_p$  : 分子の分極による項であり、 $\delta_p = (\Sigma F_p^2)^{1/2} / V$ により計算される。

$\delta_h$  : 水素結合による項であり、 $\delta_h = (\Sigma F_h / V)^{1/2}$ により計算される。

i : 溶媒 [(b)成分が相当する]

s : 溶質 [(a)成分が相当する]

$F_d, F_p, F_h$  : 分子を構成する原子団のモル引力定数

V : モル体積

【0015】ここで、 $\delta_d$ 、 $\delta_p$ 及び $\delta_h$ を求める際に用いられるモル引力定数 $F_d$ 、 $F_p$ 及び $F_h$ は、例えば  
(1) D.W.Van Krevelen, P.J.Hoflyzer "Properties of Polymers" (Elsevier, Amsterdam), 152~155(1976)、  
(2) K.E.Meusburger "Pesticide Formulation" Innovations and Developments 第14章(Am.Chem.soc., 151~162(1988)、(3) A.F.M.Barton "Handbook of Solubility Parameters and Other Cohesion Parameters" (CRC Press Inc. Boca Raton, FL)(1983)等に記載された値を用いればよい。

することができる。

【0011】前記一般式(2)で表わされるセラミドの類似構造物質は公知の方法〔例えば、ポリッシュ・ジャーナル・オブ・ケミストリー (Pol. J. Chem.) 52, 1059 (1978) ; 同52, 1283 (1978) ; 特開昭54-117421号公報、同54-144308号公報、同54-147937号公報、同62-228048号公報、同63-216852号公報〕に準じて、例えばグリシジルエーテルとエタノールとから得られる化合物のアミノ基のみを選択的にアシル化することにより得ることができる。

【0012】(a)成分としては上記の成分から選択された1種又は2種以上を組合わせて用いることができる。(a)成分は、化粧品中に0.1~50重量%配合するのが好ましく、特に0.5~30重量%、更に1~20重量%配合すると、角質層の水分保持能力が向上するため好ましい。

【0013】本発明で用いる(b)成分は、三次元溶解度パラメータ法により計算された(a)成分との相溶性値( $Ri^2$ )が30以下である油性基剤である。ここで相溶性値( $Ri^2$ )は、Hansenの式[Am.Ind.Hyg.Assoc.J., 49(6), 301-308(1988)]によって求められる次式により、計算されるものである。

【0014】

【数1】

【0016】なお、(a)成分を2種以上組合わせて用いる場合、相溶性値( $Ri^2$ )は、個々の(a)成分ごとに計算し、そのいずれもが30以下となる(b)成分を用いる。

【0017】(b)成分は、上記式によって求められる相溶性値( $Ri^2$ )が30以下のものであるが、特に好ましくは20以下、更に好ましくは10以下のものである。この相溶性値( $Ri^2$ )が30を超える場合は、

(a)成分との相溶性が低下するので化粧料の安定性が低下し、(a)成分が析出したり、粘度が著しく増減し

たりすることに加え、分離やクリーミング等も生じる。

【0018】このような(b)成分としては、多価アルコールと脂肪酸のエステル化合物が好ましく、例えば乳酸オクチルドデシル、トリ-2エチルヘキサン酸グリセリン、ジオクタン酸ネオペンテルグリコール、リンゴ酸ジイソステアリル、セスキオレイン酸ソルビタン、モノイソステアリン酸ジグリセリン、ジイソステアリン酸ジグリセリン、トリイソステアリン酸ジグリセリン、ジカプリン酸ネオペンチルグリセリン等を挙げることができる。これらのなかでも、特に乳酸オクチルドデシル、ジイソステアリン酸ジグリセリンが好ましい。

【0019】(b)成分は上記の成分から選択された1種又は2種以上を組合わせて用いることができる。

(b)成分は、化粧料中に0.1~70重量%配合するのが好ましく、特に0.5~50重量%、更に1~30重量%配合すると(a)成分との相溶性がより向上し、化粧料の安定性が向上するため好ましい。

【0020】本発明の化粧料には、更に界面活性剤及び水を配合することができる。この界面活性剤としては、化粧料成分として通常配合されるものであれば特に制限されず、例えば、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンヒマシ油、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレングルタミン酸、ポリオキシエチレンイソステアリン酸ジエステル、 $\alpha$ -モノイソステアリルグリセリルエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸モノグリセリド等のノニオン性界面活性剤；アルキル硫酸ナトリウム、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸ナトリウム、モノアルキルリン酸塩、N-ステアロイルメチルタウリン酸ナトリウム等のアニオン性界面活性剤などを挙げることができる。

【0021】界面活性剤としては上記の成分から選択された1種又は2種以上を用いることができ、これらを配合する場合の配合量は、化粧料中に0.1~8.0重量%であるのが好ましく、特に0.1~5.0重量%が好ましい。

【0022】水の配合量は剤型に応じて適宜設定することができる。0.1~99.9重量%の範囲が好ましい。また、本発明の化粧料は乳化型であることが好ましく、乳化型化粧料の場合の水の配合量は20~90重量%が好ましく、特に油中水型の場合は20~70重量%、水中油型の場合は50~90重量%が好ましい。

【0023】また、本発明の化粧料には、コレステロール、コレステロール誘導体、脂肪酸を1種または2種以上配合することができる。これらを配合することにより、保湿性及び使用感をより向上させることができる。コレステロール又はコレステロール誘導体としては、例えばコレステロール、コレスタノール、炭素数12~36、

好ましくは炭素数14~28の飽和又は不飽和の直鎖又は分岐鎖のコレステリルエステル、具体的には、イソステアリン酸コレステリル、1,2-ヒドロキシステアリン酸コレステリル、デヒドロコレステロール、ラノリン脂肪酸コレステリル、リシノール酸コレステリルなどを挙げることができる。更に、脂肪酸としては、炭素数10~25のものが好ましく、例えばラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、ベヘン酸、ウンデシレン酸、ラノリン脂肪酸、イソステアリン酸等を挙げることができる。これらのコレステロール、コレステロール誘導体、脂肪酸を配合する場合には、化粧料中に0.1~30重量%、特に0.1~15重量%配合するのが好ましい。

【0024】更に、本発明の化粧料には、本発明の目的を損なわない範囲内において、上記成分以外の通常化粧品、医薬部外品、医薬品等に用いられる各種成分、例えばアルコール、保湿剤、皮膚軟化剤、薬効剤、退色防止剤、色素、香料、防腐剤、感触向上剤、紫外線吸収剤、粉体、消炎剤、鎮痒剤、殺菌消毒剤、ホルモン剤、pH調整剤、吸油性担体等を適宜配合することができる。

【0025】本発明の化粧料は、通常の方法に従って製造することができる。例えば油中水型又は水中油型のクリーム乳液、化粧水、油性化粧料、口紅、ファンデーション、皮膚洗浄剤、ヘアートニック、整髪剤等にすることができる。

【0026】

【発明の効果】本発明の化粧料は、剤型にかかわらず保存安定性に優れ、更に、これにより(a)成分の角質層への水分保持機能を十分に発揮できるので、皮膚への保湿性付与効果に優れている。この保湿性の付与効果は、角質層の水分保持能力を改善するものであるため、持続的にその効果を発揮することができる。

【0027】

【実施例】以下、実施例により本発明を更に詳しく説明するが、本発明はこれらにより限定されるものではない。

【0028】実施例1、2及び比較例1、2

表1に示す組成の水中油型乳化化粧料を、下記製法により製造した。得られた各化粧料について、下記の方法により保湿性及び保存安定性を試験した。結果を表1に示す。

【0029】(製法)成分(1)~(9)の油相成分を80℃に加熱して溶解した。次に、油相成分中に、同温度に加熱した成分(10)~(13)及び(15)からなる水相成分を加え、乳化させた。その後、攪拌しながら(14)を加え、室温まで冷却し、水中油型乳化化粧料を得た。

【0030】(試験方法)

(1)保湿性：まず、5人のパネラーが各化粧料の一定量を前腕内側部に塗布し、3時間放置したのち、湯洗し

た。次に、温度20℃、湿度50%の恒温恒湿室に入り、30分後に角質層中の水分含有量をインピーダンスメーター（IBS社製）で測定し、保湿性を評価した。表1には、5人の平均値を表示した。

（2）保存安定性：各化粧品を、5℃、室温及び50℃でそれぞれ1月保存した場合の乳化状態を目視で観察し、次の基準により保存安定性を評価した。\*

\*○：変化がなかった。

△：粘度が著しく増加若しくは減少するか又は結晶が析出した。

×：分離又はクリーミングが生じた。

【0031】

【表1】

組 成	実施例1	実施例2	比較例1	比較例2
(1) N-(2-ヒドロキシ-3-ヘキサデシロキシプロピル)-N-2-ヒドロキシアリルヘキサデカナミド	5.0	5.0	5.0	5.0
(2) ステアリン酸	2.0	2.0	2.0	2.0
(3) コレステロールイソステアレート	3.0	3.0	3.0	3.0
(4) ジイソステアリン酸ジグリセリン(Ri <sup>2</sup> =2.6)	10.0	-	-	-
(5) 乳酸オクチルドデシル(Ri <sup>2</sup> =4.3)	-	10.0	-	-
(6) ミリスチン酸イソステアリル(Ri <sup>2</sup> =40.0)	-	-	10.0	-
(7) 流動イソパラフィン(Ri <sup>2</sup> =91.4)	-	-	-	10.0
(8) ポリオキシエチレン(40)硬化ヒマシ油	2.0	2.0	2.0	2.0
(9) セタノール	3.0	3.0	3.0	3.0
(10) グリセリン	3.0	3.0	3.0	3.0
(11) 1, 3-ブチレングリコール	3.0	3.0	3.0	3.0
(12) ブチルパラベン	0.1	0.1	0.1	0.1
(13) メチルパラベン	0.2	0.2	0.2	0.2
(14) 香料	0.1	0.1	0.1	0.1
(15) 精製水	バランス	バランス	バランス	バランス
保 湿 性 (μΩ <sup>-1</sup> )	131	133	110	108
保 存 安 定 性				
5℃	○	○	△	△
室温	○	○	○	○
50℃	○	○	×	×

【0032】表1から明らかとなおり、実施例1及び2は、いずれも保湿性及び保存安定性が優れていた。また、この保湿性は、長い時間持続させることができた。これに対して、相溶性値（Ri<sup>2</sup>）が30を大きく超えるミリスチン酸イソステアリルを用いた比較例1と、流動パラフィンを用いた2は、いずれも保湿性が劣っていた。また、比較例1及び2は室温における保存安定性は

良かったが、5℃及び50℃では保存安定性が悪かった。即ち、比較例1の場合は5℃では粘度が増加し、50℃では分離が生じた。また、比較例2の場合も5℃では粘度が増加し、50℃では分離が生じた。夏季の高温時から冬季の低温時までの使用期間を考慮すると、比較例1及び2の化粧品は製品として明らかに不良であった。